

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

51

Int. Cl.:

A 51 k, 27/06

BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

DEUTSCHES PATENTAMT



52

Deutsche Kl.: 30 h, 2/02

10

11

21

22

43

# Offenlegungsschrift 2 305 980

Aktenzeichen: P 23 05 980.5

Anmeldetag: 7. Februar 1973

Offenlegungstag: 30. August 1973

Ausstellungspriorität: —

30

Unionspriorität

32

Datum: 25. Februar 1972

33

Land: Schweiz

31

Aktenzeichen: 2720-72

54

Bezeichnung: Mineralsalz-Präparat

61

Zusatz zu: —

62

Ausscheidung aus: —

71

Anmelder: F. Hoffmann-La Roche & Co AG, Basel (Schweiz)

Vertreter gem. § 16 PatG: Werth, A. van der, Dr.-Ing.; Lederer, F., Dipl.-Chem. Dr.;  
Patentanwälte, 2000 Hamburg und 8000 München

72

Als Erfinder benannt: Meyer, Hans, Riehen (Schweiz)

DT 2305980

2305980

RAN 4250/18

F. Hoffmann-La Roche & Co. Aktiengesellschaft, Basel/Schweiz

Mineralsalz-Präparat

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Mineralsalzpräparat mit verzögerter Elektrolytfreisetzung (slow-release Form) zum fortwährenden Ersatz der bei körperlicher Belastung und erhöhter Transpiration sowie beim Gebrauch von Diuretika verlorenen Mineralsalze.

Bekanntlich führen die Elektrolytverluste durch erhöhte Transpiration oder Einnahme von Diuretika zu schwerwiegenden Stoffwechselstörungen, die sich in Muskelschmerzen, Nausea, Erbrechen, Magen-Darmkrämpfen, Muskelkrämpfen, Schock, langen Erholungszeiten sowie starkem Leistungsabfall manifestieren.

Um diese Mangerscheinungen zu vermeiden, ist es bekannt, Menschen, welche in heissem Klima, z.B. Sport oder schwere Arbeit ausüben, Natrium-Ionen zuzugeben. In diesem

Hen/8.12.72

309835/1081

2305980

Zusammenhang haben sich die sogenannten "slow-release"-Tabletten besonders bewährt. Diese Tabletten besitzen für die Elektrolyte eine Abgabezeit von einigen Stunden, was bei länger andauernder Belastung eine fortwährende Substitution der ausgeschiedenen Salze gewährleistet, und z.B. für Ausdauersportler von höchster Bedeutung ist. Weiter haben solche "slow-release"-Tabletten den Vorteil, dass keine erhöhte Ausscheidung wie sie bei der Einnahme schnelllöslicher Tabletten bekannt geworden ist, stattfindet und dass nur kleine Mengen freigesetzt werden, wodurch eine optimale Resorption der Elektrolyte gewährleistet wird.

Die bisher bekannten "slow-release"-Präparate enthalten jedoch überwiegend Natrium-Ionen und sind aus folgenden Gründen besonders bei Sportlern nicht ganz befriedigend.

Beim Transpirieren übersteigt der Wasserverlust, welcher je nach Sportart bis zu 5 Liter betragen kann, deutlich den Natriumverlust, wobei, trotz der Natrium-Ionen-Ausscheidung der Natriumspiegel im Serum ansteigt, während die Serumwerte der anderen wichtigen Elektrolytbestandteilen wie z.B. Calcium-Ionen, Magnesium-Ionen und Kalium-Ionen absinken. Zusätzlich ist noch bekannt, dass Natrium-Ionen die Resorption der anderen physiologisch wichtigen Elektrolytbestandteile Calcium-Ionen und Magnesium-Ionen konkurrenzieren. Im einzelnen ist bekannt, dass die Einnahme von Natrium-Ionen eine erhöhte Ausscheidung von Magnesium-Ionen zur Folge hat.

Da speziell bei der Sportausübung während der Wettkämpfe und dem Training auf die Einnahme grosser Flüssigkeitsmengen verzichtet wird, bedeutet eine Zufuhr der bisher üblichen Mengen von Natrium-Ionen aus den genannten Gründen eine zusätzliche Belastung für den Organismus.

Ausserdem wird der tägliche Bedarf an Natrium-Ionen bekanntlich durch die Nahrung in ausreichendem Masse gedeckt,

309835/1081

2305980

während dem durch körperliche Belastung noch zusätzlich erhöhten Bedarf der anderen Elektrolyte nur unzureichend Rechnung getragen wird. So wird z.B. der hohe tägliche Bedarf an Magnesium-Ionen von 6-10 mg/kg Körpergewicht durch die Ernährung in Industrienationen nicht gedeckt, so dass ein zusätzlicher Verlust durch erhöhte Transpiration zu physiologischen Störungen führt.

Es war nun Zweck der vorliegenden Erfindung ein Präparat zur Verfügung zu stellen, welches die vorstehend erwähnten Nachteile nicht aufweist.

Dies wird erfindungsgemäss durch ein Mineralsalzpräparat in slow-release-Form erreicht, worin die wichtigen Elektrolytbestandteile Kalium-Ionen, Magnesium-Ionen und Calcium-Ionen in einem Verhältnis vorhanden sind, welches dem erhöhten Bedarf bei körperlicher Belastung sowie den Resorptionsraten der einzelnen Ionen Rechnung trägt.

Genauer gesagt, betrifft die Erfindung ein Mineralsalzpräparat mit verzögerter Elektrolytfreisetzung zum fortwährenden Ersatz der bei körperlicher Belastung und erhöhter Transpiration oder bei Gebrauch von Diuretika verlorenen Mineralsalze, welches dadurch gekennzeichnet ist, dass es in Form von Salzen 5 bis 80 Gewichtsteile Calcium, 5 bis 40 Gewichtsteile Magnesium, 2 bis 20 Gewichtsteile Kalium kein Natrium oder weniger als 20 Gewichtsteile Natrium enthält, wobei das Gewichtsverhältnis von Calcium, Magnesium, Kalium und Natrium zum Gesamtgewicht des Präparates über 10% liegt.

Die Elektrolytbestandteile Calcium-Ionen, Magnesium-Ionen, Kalium-Ionen und gegebenenfalls Natrium-Ionen können mit allen für eine "slow-release"-Form geeigneten Anionen sowohl in Form anorganischer Salze, wie beispielsweise Halogenide, Sulfate oder Phosphate als auch in Form von organischen Salzen, wie z.B. Tartraten, Zitraten oder

309835/1081

2305980

Ascorbaten, eingesetzt werden.

Das erfindungsgemäße "slow-release" Mineralsalzpräparat kann zusätzlich Vitamine wie die wasserlöslichen Vitamine C, B<sub>1</sub> und B<sub>6</sub> und Hilfsstoffe wie z.B. Konservierungsmittel, Lösungsvermittler oder Lösungshemmer enthalten und kann in irgendeiner für ein "slow-release"-Präparat geeigneten Verabreichungsform wie z.B. in Form von Tabletten, Dragées und Kapseln appliziert werden.

Das erfindungsgemäße "slow-release"-Mineralsalzpräparat wird mit Vorteil in Form von Tabletten verabreicht. Besonders bevorzugt sind Tabletten, welche eine Matrix aus Natur- oder Kunststoff wie z.B. Wachs besitzen. Als Wachs wird gehärtetes Rizinusöl ganz besonders bevorzugt.

Die Abgabezeit für die Elektrolyte beträgt 2-5 Stunden, in der Regel 3 bis 4 Stunden. Mit Vorteil wird eine Dosis in 4 bis 8 Tabletten aufgeteilt, wobei eine Aufteilung in 6 Tabletten bevorzugt ist.

Das vorliegende Beispiel dient zur Illustration der Erfindung:

#### Beispiel

Zusammensetzung einer Tablette eines "slow-release"-Mineralsalzpräparat in Bezug auf die Salze:

Ca-glycerophosphat	218,0	mg	=	41,66 mg Ca <sup>++</sup>
Mg-glycerophosphat	227,5	mg	=	28,33 mg Mg <sup>++</sup>
NaCl	42,35	mg	=	16,67 mg Na <sup>+</sup>
KCl	31,85	mg	=	16,67 mg K <sup>+</sup>

Bei 6 Tabletten täglich werden demnach 250 mg Ca<sup>++</sup>  
170 mg Mg<sup>++</sup>  
und je 100 mg Na<sup>+</sup> und K<sup>+</sup>

309835/1081

2305980

zugeführt.

Zur Erhöhung der Löslichkeit des Calcium-Salzes wird zusätzlich noch 45 mg Zitronensäure pro Tablette zugefügt.

Die Tabletten besitzen eine Matrix aus gehärtetem Rizinusöl.

309835/1081



2305980

Patentansprüche

① Mineralsalzpräparat mit verzögerter Elektrolytfreisetzung, zum fortwährenden Ersatz der bei körperlicher Belastung und erhöhter Transpiration sowie beim Gebrauch von Diuretika verlorenen Mineralsalze, welches dadurch gekennzeichnet ist, dass es in Form von Salzen 5 bis 80 Gewichtsteile Calcium 5 bis 40 Gewichtsteile Magnesium 2 bis 20 Gewichtsteile Kalium kein Natrium oder weniger als 20 Gewichtsteile Natrium enthält, wobei das Gewichtsverhältnis von Calcium, Magnesium, Kalium und Natrium zum Gesamtgewicht des Präparates über 10% liegt.

2. Mineralsalzpräparat nach Anspruch 1 in Form von Tabletten.

3. Mineralsalzpräparat nach einem der Ansprüche 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass es Calciumglycerophosphat, Magnesiumglycerophosphat, Natriumchlorid und Kaliumchlorid enthält.

4. Mineralsalzpräparat nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass es zusätzlich Zitronensäure enthält.

5. Mineralsalzpräparat nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass es 218,0 mg Calciumglycerophosphat, 227,5 mg Magnesiumglycerophosphat, 42,35 mg Natriumchlorid, 31,85 mg Kaliumchlorid und 45 mg Zitronensäure enthält.

2305980

6. Verfahren zur Herstellung von Mineralsalzpräparaten mit verzögerter Elektrolytfreisetzung zum fortwährenden Ersatz der bei körperlichen Belastung und erhöhter Transpiration sowie beim Gebrauch von Diuretika verlorenen Mineralsalze, dadurch gekennzeichnet, dass man Salze, welche 5 bis 80 Gewichtsteile Calcium, 5 bis 40 Gewichtsteile Magnesium, 2 bis 20 Gewichtsteile Kalium und kein Natrium oder weniger als 20 Gewichtsteile Natrium in einem Gewichtsverhältnis das im Vergleich zum Gesamtgewicht des Präparates über 10% liegt enthalten, mit in solchen Präparaten üblichen Zusätzen mischt.

7. Verfahren nach Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, dass man als Salze Calciumglycerophosphat, Magnesiumglycerophosphat, Natriumchlorid und Kaliumchlorid verwendet.

8. Verfahren nach Anspruch 6 oder 7, dadurch gekennzeichnet, dass man Zitronensäure zusetzt.

9. Verfahren nach einem der Ansprüche 6 bis 8, dadurch gekennzeichnet, dass man 218,0 mg Calciumglycerophosphat, 227,5 mg Magnesiumglycerophosphat, 42,35 mg Natriumchlorid, 31,85 mg Kaliumchlorid und 45 mg Zitronensäure verwendet.

309835/1081